

## PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2002-003358

(43)Date of publication of application : 09.01.2002

---

(51)Int.Cl.

A61K 7/48  
A61K 7/00  
A61K 7/021  
A61K 31/222  
A61K 35/78  
A61P 17/00  
A61P 43/00

---

(21)Application number : 2000-188937

(71)Applicant : SHISEIDO CO LTD

(22)Date of filing : 23.06.2000

(72)Inventor : TOKUE WATARU

---

### (54) SKIN CARE PREPARATION

(57)Abstract:

**PROBLEM TO BE SOLVED:** To obtain a skin care preparation capable of preventing flabby skin, deletion of gloss, or the like, besides prevention of chapped skin and improvement in chapped skin and having a high effect on prevention of aging.

**SOLUTION:** This skin care preparation is obtained by formulating one or more kinds of extracted solutions of plants selected from *Sophora angustifolia*, *Acacia catechu*, *Eugenia aromatica*, *Saxifraga stolonifera*, hop, rosemary, lithospermum root, *Hypericum erectum* Thunb, *Hypericum perforatum* L. and tea with tranexamic acid as active ingredients.

**\* NOTICES \***

JPO and INPIT are not responsible for any damages caused by the use of this translation.

1.This document has been translated by computer. So the translation may not reflect the original precisely.

2.\*\*\*\* shows the word which can not be translated.

3.In the drawings, any words are not translated.

---

**CLAIMS**

---

[Claim(s)]

[Claim 1]Skin external preparations for a surface deterioration improvement blending a kind of an extract of vegetation chosen from Clara, cube gambir, caryophylli flos, creeping saxifrage, hop, a rosemary, a lithospermi radix, a St. John's wort, a SEIYOU St. John's wort, and tea or two sorts or more, and tranexamic acid as an active principle.

[Claim 2]Skin external preparations for aging prevention blending a kind of an extract of vegetation chosen from Clara, cube gambir, caryophylli flos, creeping saxifrage, hop, a rosemary, a lithospermi radix, a St. John's wort, a SEIYOU St. John's wort, and tea or two sorts or more, and tranexamic acid as an active principle.

[Claim 3]The skin external preparations according to claim 1 or 2 whose loadings of tranexamic acid loadings of a plant extract are 0.00001 to 0.1 % of the weight as a dry solid, and are 0.01 to 10.0 % of the weight.

---

[Translation done.]

**\* NOTICES \***

JPO and INPIT are not responsible for any damages caused by the use of this translation.

- 1.This document has been translated by computer. So the translation may not reflect the original precisely.
- 2.\*\*\* shows the word which can not be translated.
- 3.In the drawings, any words are not translated.

---

**DETAILED DESCRIPTION**

---

[Detailed Description of the Invention]

[0001]

[Field of the Invention]This invention relates to the high skin external preparations of an effect which prevent the sag of the skin besides surface deterioration prevention and a surface deterioration improvement, disappearance of gloss, etc., and prevent aging in more detail about skin external preparations.

[0002]

[Description of the Prior Art]Although tranexamic acid was used for drugs as an anti-inflammatory agent and it had also turned out conventionally that there is a surface deterioration improvement effect these days, antiaging effects were not yet enough and did not reach for expecting an effect. What has the further effect also about a surface deterioration improvement effect was called for.

[0003]

[Means for Solving the Problem]As a result of inquiring wholeheartedly in order that there may be not no method of heightening an effect of this invention persons being excellent in surface deterioration prevention and a surface deterioration improving action, preventing sag of the skin, disappearance of gloss, etc., and preventing aging, a specific plant extract, By blending tranexamic acid, it finds out that this purpose can be attained and came to complete this invention.

[0004]

[Means for Solving the Problem]Namely, a kind of a vegetable extract or two sorts or more as which this invention is chosen from Clara, cube gambir, caryophylli flos, creeping saxifrage, hop, a rosemary, a lithospermi radix, a St. John's wort, a SEIYOU St. John's wort, and tea, It is skin external preparations for a surface deterioration improvement and skin external preparations for aging prevention blending tranexamic acid as an active principle.

[0005]it is already known that each vegetable extract used for this invention has elastase inhibitory action (JP,10-17460,A.) JP,10-182414,A, JP,11-246337,A, Refer to JP,11-246338,A, JP,11-246385,A, JP,11-2466386,A, JP,11-246387,A, JP,11-246388,A, and JP,11-315008,A.

Loadings of these plant extracts are 0.0001 to 0.1 % of the weight preferably 0.00001 to 0.1% of the weight among the skin external-preparations whole quantity. At less than 0.00001 % of the weight, if the effect is not demonstrated but 0.1 % of the weight is exceeded, since precipitate arises in temporality, it is not preferred on stability.

[0006]Although loadings of tranexamic acid in this invention do not have limitation in particular, it is preferably blended 0.1 to 5.0% of the weight still more preferably 0.01 to 10.0% of the weight into the skin external-preparations whole quantity.

[0007]Other ingredients usually used for skin external preparations other than the essential ingredient above-mentioned to skin external preparations of this invention, such as cosmetics and drugs, For example, an avocado oil, palm oil, peanut oil, rice bran oil, jojoba oil, Kalna Barrow, lanolin, a liquid paraffin, oxystearic acid, pulmitic acid isostearyl, Oil, such as isostearyl alcohol; Glycerin, sorbitol, a polyethylene glycol, Pyrrolidone carboxylic acid and its salt, collagen, hyaluronic acid, and its salt, Moisturizers, such as chondroitin sulfate and its salt; Para

dimethylaminobenzoic acid amyl, Ultraviolet ray absorbents, such as urocanic acid and diisopropyl cinnamoyl acid ethyl; Sodium erythorbate, Antioxidants, such as a sage extract and p-hydroxyanisole; Stearyl sodium sulfate, Sept Iles sulfuric acid diethanolamine, Sept Iles trimethylammonium saccharin, Surface-active agents, such as polyethylene-glycol isostearic acid and arachidic acid glyceryl; Ethylparaben, Antiseptics, such as butylparaben; A cork tree bark, a coptis root, a loquat, a peony, a sialid, a birch, a ginseng, an aloe, a mallow, an iris, a grape, a coix seed, a sponge gourd, a lily, a crocus, a cnidium rhizome, Extracts, such as a ginger, Ononis spinosa, and a garlic; A glycyrrhizin acid derivative, A glycyrrhetic acid derivative, salicylic acid derivatives, hinokitiol, a zinc oxide, Antiphlogistics, such as allantoin; Whitening agent; royal jelly, such as a placenta extract, glutathione, and an ascorbic acid derivative, Activators, such as sensitization matter, a cholesterol derivative, and various amino acid; \*\*--oryzanol, Circulation accelerators, such as dextran sulfate sodium; coloring materials, such as thickener; titan yellow, such as antiseborrheic drug; perfume; water; alcoholic; carboxyvinyl polymers, such as sulfur and thianthol, car SAMIN, and carthami flos red, etc. can be blended suitably if needed.

[0008] A pharmaceutical form of skin external preparations of this invention may be arbitrary, and what kind of pharmaceutical form may be sufficient as a solution system, a solubilization system, an emulsification system, a powder dispersed system, a water-oil bilayer system, water-oil-powder 3 layer system, etc.

[0009] A use of skin external preparations of this invention is also arbitrary, and it can use for makeup cosmetics and body cosmetics, such as facial cosmetics, such as face toilet, a milky lotion, cream, and a pack, foundation, a lip stick, and eye shadow, a charge of washing, ointment, etc.

[0010]

[Example] Next an example and a comparative example are given and this invention is clarified concretely. Thereby, this invention is not limited. Loadings are weight %.

[0011] It prepared by the method of mentioning Examples 1-10, the comparative example 1 - the cream of a formula of 12 following later.

A. Cetanol 0.5 Weight % vaseline 2.0. Squalane 7.0 Self-emulsification type glyceryl monostearate . 2.5 Polyoxyethylene sorbitan Monostearin acid ester (20EO) 1.5 Punt thenyl ethyl ether 0.5 jojoba-oil 5.0 B. dipropylene glycol 5.0 1,3-butylene-glycol 5.0. veegum (montmorillonite) -- the 5.0 plant-extract (as dry solid) table 1 - the Table 3 statement Tranexamic acid Table 1 - the Table 3 statement potassium hydrate [ ] -- 0.3 water It remains.[0012] (Process) Complete dissolution of A (oil phase) and the B (aqueous phase) is heated and carried out to 70 \*\*, respectively. A is added to B and it emulsifies with an emulsion machine. The emulsified matter was cooled using the heat exchange mechanism, and cream was obtained.

[0013]

[Table 1]

Example 1 2 3 4 5 6 7 8.											
Clara extract	0.001										
cube gambir extract		0.001									
caryophylli flos extract			0.001								
creeping saxifrage extract				0.001							
hop extract					0.001						
rosemary extract						0.001					
lithospermi radix extract							0.001				
St. John's wort extract								0.001			
tranexamic-acid	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0

[0014]

[Table 2]

Example 9 Ten comparative example 1 2 3 4 5 6.											
SEIYOUOTO The GIRISOU extract	0.001										
tea extract		0.001									
Clara extract			0.001								
cube gambir extract				0.001							
caryophylli flos extract					0.001						
creeping saxifrage extract						0.001					
hop extract							0.001				
tranexamic-acid	2.0	2.0	2.0								

[0015]

[Table 3]

Comparative example 7 8 9 10 11 12.											
Rosemary extract	0.001										
lithospermi radix extract		0.001									
St. John's wort extract			0.001								
SEIYOUOTO GIRISOU extract				0.001							
tea					0.001						

extract - - - - 0.001 - tranexamic acid - - - - - . -----

[0016]The human body panel performed surface deterioration prevention, surface deterioration improvement effect examination, and evaluation about sag and gloss of the skin using the cream obtained by Examples 1-10 and the comparative examples 1-12.

[0017]That is, about surface deterioration prevention and a surface deterioration improvement effect, the replica of skin is taken using the replica method according female healthy people's (face) skin surface gestalt to silicone resin, and it observes under a microscope (17 times).

leather -- using those [ 110 ] who were judged to be the surface deterioration evaluations 1 and 2 based on the standard shown in Table 4 from the state of a crest, and the desquamative state of the horny layer (surface deterioration panel), Bis die spreading was assigned and carried out so that 22 sorts of cream obtained to face right-and-left half-and-half by Examples 1-10 and the comparative examples 1-12 might be applied to each by ten persons. The replica of each face right and left was taken again two weeks afterward, the state of skin was observed, and it evaluated in accordance with the decision criterion of Table 4. The result is shown in Tables 5 and 6.

[0018>About sag and gloss of skin, \*\* view evaluation of the skin state before and behind use of the above-mentioned panel was carried out. The result is collectively shown in Tables 5 and 6.

[0019](\*\* view evaluation)

O : skin has a beam dramatically and there is no sag.

O : skin has a beam a little and there is no sag.

\*\* : There is no beam in skin not much, and he has sensibility which curtained.

x: There is no beam in skin and it is slack.

[0020]

[Table 4]

----- marks an evaluation ----- 1 hide

slot -- leather -- disappearance of a hill. A wide range horny layer should turn over.

2 a leather slot -- leather -- a hill is indistinct. A horny layer should turn over.

3 a leather slot -- leather -- flat, although a hill is accepted.

4 a leather slot -- leather -- a hill is clear.

5 a leather slot -- leather -- a hill is clear and ready.

-----[0021]

[Table 5]

----- . Example 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10. -----

----- . Replica evaluation 1 0 0 0 0 0 0 0 0 0 2 0 1 1 0 0 1 0 0 1 0 3 2 1 0 2 3 2 1 2 2 2 4 2 2

3 1 1 2 3 2 1 1 5 6 6 6 7 6 5 6 6 6 7. ----- . \*\* view evaluation

Before use O 0 1 1 0 0. 1 1 0 0 0 0 2 2 3 2. 1 4 2 3 3 2 \*\* 5 4 5. 6 4 4 3 5 4 3x3 3. 1 2 5 1 4 2 3

After 5 use O 4 4 3 5 4 3 5 4 5 3 0 6 5 6 3 3 5 5 4 4 5 \*\* 0 1 1 2 3 2 0 2 1 2x0 0 0 0 0 0 0 0 0 0.

-----[0022]

[Table 6]

----- . Comparative example 1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 11 12. -----

----- . Replica evaluation 1 1 3 2 4 2 1. 3 4 3 3 4 6 2 3 5 5 4 6 5 4 5

5 4 3 4 3 3 1 1 1 2 2 1 0 1 1 2 0 4 2 1 2 1 0 2 2 1 1 2 1 0 5 1 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0. -----

----- . \*\* view evaluation Before use O 0 0 0 0 0. 0 0 0 0 0 0 0 0 2 3. 1 0 2 1

2 2 0 1 3 0. \*\* 3 4 5 6 2 5 4 7 7. 5 4 6x5 3 4 4 6 4. 4 1 3 4 3 Four After use O 1 0 1 0 1 0 0 0 1

0 0 0 0 5 2 2 1 2 3 2 1 1 2 2 1 \*\* 3 5 4 5 6 4 3 4 5 4 6 5x1 3 3 4 1 3 5 5 3 4 2 4. -----

-----[0023]It turns out that the face part which uses the cosmetics which

blended a plant extract more specific than the result of Tables 5 and 6 and tranexamic acid improves substantially as compared with the face part which uses other cosmetics also about that remarkable surface deterioration prevention and surface deterioration improvement effect are accepted and the sag of skin, and gloss.

[0024]

Example 11 Cream A. stearic acid 10.0. Weight % stearyl alcohol 4.0 butyl-stearate . 8.0 Stearic acid monoglycerol ester . 2.0 Vitamin-E acetate 0.5 vitamin-A palmitate 0.1 Macadamia-nuts oil 1.0 perfume 0.4 antiseptic Optimum dose B. glycerin 4.0 1 and 2 pentanediol 3.0 Pyrola japonica

extract 1.0. Potassium hydrate 0.4 Clara extract (as a dry solid.) 0.01 tranexamic-acid 0.1 ascorbic-acid magnesium phosphate 0.1 L-arginine hydrochloride 0.01 erythritol 1.0 edetate trisodium 0.05 purified water Complete dissolution of the oil phase part of the emalnder (process) A and the water phase part of B is heated and carried out to 70C, respectively. An A phase is added to a B phase and it emulsifies with an emulsion machine. The emulsified matter was cooled using the heat exchange mechanism, and cream was obtained.

[0025]

Example 12 Cream A. cetanol 4.0 % of the weight . Vaseline 7.0 Isopropyl-myristate . 8.0 Squalane 15.0 stearic-acid monoglycerol ester 2.2 POE(20) sorbitan monostearate 2.8 vitamin-E nicotinate 2.0 Perfume 0.3 antioxidant Optimum dose Antiseptic Optimum dose B. glycerin . 10.0 Dokudami extract 0.01 dipropylene-glycol 4.0 St. John's wort extract (as a dry solid.) 0.1 tranexamic acid 5.0 pyrrolidone-carboxylic-acid sodium 1.0 lysine 3.0 disodium edetate 0.01 purified water Cream was obtained according to the residual (process) example 11.

[0026]

Example 13 Milky lotion A. squalane 5.0. Weight % oleyl olate 3.0 Vaseline . 2.0 Sorbitan sesquioleate . 0.8 Polyoxyethylene oleylether (20EO). 1.2 Oenotherae Biennis oil 0.5 perfume 0.3. Antiseptic optimum dose B.1,3-butylene-glycol 4.5 Melissa extract 1.5 ethanol 3.0 carboxyvinyl-polymer 0.2 potassium hydrate 0.1 L-arginine L-aspartic acid salt 0.01 caryophylli-flos extract (as a dry solid.) 0.0001 tranexamic acid The milky lotion was obtained according to the 0.5 erythritol 0.5 hexametaphosphoric-acid sodium 0.05 residual-purified-water (process) example 11.

[0027]

Example 14 Foundation A. cetanol . 3.5 Weight % deodorization lanolin 4.0 jojoba-oil . 5.0 vaseline 2.0 Squalane 6.0. Stearic acid monoglycerol ester 2.5. POE (60) hydrogenated castor oil 1.5 POE (20) Sept Iles ether 1.0 pyridoxine tripalmitate 0.1 antiseptic Optimum dose Perfume 0.3B. propylene glycol 10.0 preparation powder 12.0 L-arginine . 5.0 Cube gambir extract (as dry solid) 0.05 tranexamic-acid 0.05 edetate trisodium 0.2 purified water Foundation was obtained according to the residual (process) example 11.

[0028]

Example 15 Face toilet A. ethanol 5.0. Weight % POE oleyl alcohol ether . 2.0 2-ethylhexyl-P-dimethylamino benzoate 0.18 Perfume 0.05B.1,3-butylene-glycol 9.5 pyrrolidone-carboxylic-acid sodium 0.5 hyaluronate sodium 0.01 lithospermi-radix extract (as a dry solid.) 0.00001 tranexamic-acid 10.0 nicotinamide 0.3 glycerin 5.0 hydroxypropyl beta cyclodextrin 1.0 purified water The alcoholic phase of the emalnder (process) A was added and solubilized to the aqueous phase of B, and face toilet was obtained.

[0029]

Example 16 pack (1) polyvinyl-alcohol 10.0 Weight %(2) polyethylene-glycol (molecular weight 400) 0.4(3) glycerin 3.0(4) ethanol (95%) 8.0(5) creeping-saxifrage extract (as a dry solid.) 0.1 (6) tranexamic-acid 1.0 (7) antiseptic 0.1 (8) perfume 0.1 (9) purified water At a residual (process) room temperature, (4), The mixture solution of (7) and (8) was carried out, after carrying out stirring addition in the inside which carried out the mixture solution of (1), (2), (3) and (5), (6), and (9) by 80C, it cooled radiationally to the room temperature and the pack was obtained.

[0030]

[Effect of the Invention]as explained above, the skin external preparations of this invention have an advantage to which the effect of preventing the sag of a surface deterioration improvement effect and the skin, disappearance of gloss, etc., and preventing aging by blending a vegetable extract with the elastase inhibition effect and tranexamic acid can be made to increase remarkably.

[Translation done.]

(19) 日本国特許庁 (J P)

## (12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2002-3358

(P2002-3358A)

(43) 公開日 平成14年1月9日 (2002. 1. 9)

(51) Int.Cl. <sup>7</sup>	識別記号	F I	テマコード <sup>*</sup> (参考)
A 6 1 K	7/48	A 6 1 K	4 C 0 8 3
	7/00	7/00	C 4 C 0 8 8
			K 4 C 2 0 6
			N
			M
審査請求 未請求 請求項の数 3 O L (全 8 頁) 最終頁に続く			

(21) 出願番号 特願2000-188937 (P2000-188937)

(22) 出願日 平成12年6月23日 (2000. 6. 23)

(71) 出願人 000001959

株式会社資生堂

東京都中央区銀座7丁目5番5号

(72) 発明者 徳江 渡

神奈川県横浜市港北区新羽町1050番地 株

式会社資生堂第一リサーチセンター内

(74) 代理人 100090527

弁理士 館野 千恵子

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 皮膚外用剤

(57) 【要約】

【課題】 肌荒れ防止、肌荒れ改善のほか、皮膚のたるみ、つやの消失などを防いで老化を防止する効果の高い皮膚外用剤を提供する。

【解決手段】 クララ、アセンヤク、チョウジ、ユキノシタ、ホップ、ローズマリー、シコン、オトギリソウ、セイヨウオトギリソウおよびチャから選ばれる植物の抽出液の一種または二種以上と、トラネキサム酸とを有効成分として配合する。

**【特許請求の範囲】**

**【請求項 1】** クララ、アセンヤク、チョウジ、ユキノシタ、ホップ、ローズマリー、シコン、オトギリソウ、セイヨウオトギリソウおよびチャから選ばれる植物の抽出液の一種または二種以上と、トラネキサム酸とを有効成分として配合することを特徴とする肌荒れ改善用皮膚外用剤。

**【請求項 2】** クララ、アセンヤク、チョウジ、ユキノシタ、ホップ、ローズマリー、シコン、オトギリソウ、セイヨウオトギリソウおよびチャから選ばれる植物の抽出液の一種または二種以上と、トラネキサム酸とを有効成分として配合することを特徴とする老化防止用皮膚外用剤。

**【請求項 3】** 植物抽出物の配合量が乾燥固形分として 0.00001～0.1 重量%であり、トラネキサム酸の配合量が 0.01～10.0 重量%である請求項 1 または 2 記載の皮膚外用剤。

**【発明の詳細な説明】****【0001】**

**【発明の属する技術分野】** 本発明は皮膚外用剤に関し、さらに詳しくは肌荒れ防止、肌荒れ改善のほか、皮膚のたるみ、つやの消失などを防いで老化を防止する効果の高い皮膚外用剤に関する。

**【0002】**

**【従来の技術および発明が解決しようとする課題】** 従来、トラネキサム酸は抗炎症剤として医薬品に使用され、最近では肌荒れ改善効果があることも分かっていたが、老化防止効果はいまだ十分でなく効果を期待するにはおよばなかった。また、肌荒れ改善効果についてもさらなる効果を有するものが求められていた。

**【0003】**

**【課題を解決するための手段】** 本発明者らは肌荒れ防止、肌荒れ改善作用に優れ、皮膚のたるみ、つやの消失などを防いで老化を防止する効果を高める方法はないものかと鋭意研究した結果、特定の植物抽出物と、トラネキサム酸とを配合することによって、この目的が達成できることを見出し、本発明を完成するに至った。

**【0004】**

**【課題を解決するための手段】** すなわち、本発明は、クララ、アセンヤク、チョウジ、ユキノシタ、ホップ、ローズマリー、シコン、オトギリソウ、セイヨウオトギリソウおよびチャから選ばれる植物の抽出液の一種または二種以上と、トラネキサム酸とを有効成分として配合することを特徴とする肌荒れ改善用皮膚外用剤および老化防止用皮膚外用剤である。

**【0005】** 本発明に用いられる植物抽出液はいずれもエラスターゼ阻害作用のあることがすでに知られているものである（特開平 10-17460 号公報、特開平 10-182414 号公報、特開平 11-246337 号公報、特開平 11-246338 号公報、特開平 11-

246385 号公報、特開平 11-2466386 号公報、特開平 11-246387 号公報、特開平 11-246388 号公報、特開平 11-315008 号公報参照）。これらの植物抽出物の配合量は、皮膚外用剤全量中、0.00001～0.1 重量%、好ましくは 0.0001～0.1 重量%である。0.00001 重量%未満ではその効果は発揮されず、0.1 重量%を越えると、経時で沈殿が生じるため安定性上好ましくない。

**【0006】** 本発明におけるトラネキサム酸の配合量は特に限定はないが、好ましくは皮膚外用剤全量中に、0.01～10.0 重量%、さらに好ましくは、0.1～5.0 重量%配合される。

**【0007】** 本発明の皮膚外用剤には上記した必須成分の他に、通常化粧品や医薬品等の皮膚外用剤に用いられる他の成分、例えばアボガド油、パーム油、ピーナツ油、コメヌカ油、ホホバ油、カルナバロウ、ラノリン、流動パラフィン、オキシステアリン酸、パルミチン酸イソステアリル、イソステアリルアルコール等の油分；グリセリン、ソルビトール、ポリエチレングリコール、ピロリドンカルボン酸およびその塩、コラーゲン、ヒアルロン酸およびその塩、コンドロイチン硫酸およびその塩等の保湿剤；パラジメチルアミノ安息香酸アミル、ウロカニン酸、ジイソプロピルケイヒ酸エチル等の紫外線吸収剤；エリソルビン酸ナトリウム、セージエキス、パロヒドロキシアニソール等の酸化防止剤；ステアリル硫酸ナトリウム、セチル硫酸ジエタノールアミン、セチルトリメチルアンモニウムサッカリン、イソステアリン酸ポリエチレングリコール、アラキシン酸グリセリル等の界面活性剤；エチルパラベン、ブチルパラベン等の防腐剤；オウバク、オウレン、ビワ、シャクヤク、センブリ、バーチ、ニンジン、アロエ、ゼニアオイ、アイリス、ブドウ、ヨクイニン、ヘチマ、ユリ、サフラン、センキュウ、ショウキョウ、オノニス、ニンニク等の抽出物；グリチルリチン酸誘導体、グリチルレチン酸誘導体、サリチル酸誘導体、ヒノキチオール、酸化亜鉛、アラントイン等の消炎剤；胎盤抽出物、グルタチオン、アスコルビン酸誘導体等の美白剤；ローヤルゼリー、感光素、コレステロール誘導体、各種アミノ酸類等の賦活剤；γ-オリザノール、デキストラン硫酸ナトリウム等の血行促進剤；硫黄、チアントール等の抗脂漏剤；香料；水；アルコール；カルボキシビニルポリマー等の増粘剤；チタニエロー、カーサミン、ベニバナ赤等の色剤等を必要に応じて適宜配合することができる。

**【0008】** 本発明の皮膚外用剤の剤型は任意であり、溶液系、可溶化系、乳化系、粉末分散系、水-油二層系、水-油-粉末三層系等、どのような剤型でも構わない。

**【0009】** また、本発明の皮膚外用剤の用途も任意であり、化粧水、乳液、クリーム、パック等のフェーシャル化粧品やファンデーション、口紅、アイシャドー等の



メーキャップ化粧料やボディー化粧料、洗浄料、軟膏等に用いることができる。

# 【0010】

【実施例】つぎに実施例および比較例をあげて、本発明

A. セタノール	0.5 重量%
ワセリン	2.0
スクワラン	7.0
自己乳化型モノステアリン酸グリセリン	2.5
ポリオキシエチレンソルビタン	
モノステアリン酸エステル (20EO)	1.5
パントテニルエチルエーテル	0.5
ホホバ油	5.0
B. ジブロピレングリコール	5.0
1, 3-ブチレングリコール	5.0
ビーガム (モンモリロナイト)	5.0
植物抽出物 (乾燥固形分として)	表1～表3記載
トラネキサム酸	表1～表3記載
水酸化カリウム	0.3
水	残余

【0012】(製法) A (油相) と B (水相) をそれぞれ 20 リームを得た。  
れ70℃に加熱し、完全溶解する。AをBに加えて、乳  
化機で乳化する。乳化物を熱交換機を用いて冷却してク

を具体的に明らかにする。本発明はこれにより限定されるものではない。配合量は重量%である。

# 【0011】実施例1～10、比較例1～12

下記の処方のクリームを後述する方法で調製した。

# 【0013】

## 【表1】

実施例	1	2	3	4	5	6	7	8
クララ抽出物	0.001	—	—	—	—	—	—	—
アセンヤク抽出物	—	0.001	—	—	—	—	—	—
チョウジ抽出物	—	—	0.001	—	—	—	—	—
ユキノシタ抽出物	—	—	—	0.001	—	—	—	—
ホップ抽出物	—	—	—	—	0.001	—	—	—
ローズマリー抽出物	—	—	—	—	—	0.001	—	—
シコン抽出物	—	—	—	—	—	—	0.001	—
オトギリソウ抽出物	—	—	—	—	—	—	—	0.001
トラネキサム酸	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0	2.0

# 【0014】

## 【表2】

実施例	9	10						
比較例			1	2	3	4	5	6
セイヨウオト								
ギリソウ抽出物	0.001	—	—	—	—	—	—	—
チャ抽出物	—	0.001	—	—	—	—	—	—
クララ抽出物	—	—	—	0.001	—	—	—	—
アセンヤク抽出物	—	—	—	—	0.001	—	—	—
チョウジ抽出物	—	—	—	—	—	0.001	—	—
ユキノシタ抽出物	—	—	—	—	—	—	0.001	—
ホップ抽出物	—	—	—	—	—	—	—	0.001
トラネキサム酸	2.0	2.0	2.0	—	—	—	—	—

【0015】

【表3】

比較例	7	8	9	10	11	12
ローズマリー抽出物	0.001	—	—	—	—	—
シコン抽出物	—	0.001	—	—	—	—
オトギリソウ抽出物	—	—	0.001	—	—	—
セイヨウオト ギリソウ抽出物	—	—	—	0.001	—	—
チャ抽出物	—	—	—	—	0.001	—
トラネキサム酸	—	—	—	—	—	—

【0016】実施例1～10および比較例1～12で得られたクリームを用いて人体パネルで肌荒れ防止および肌荒れ改善効果試験、ならびに皮膚のたるみとつやについての評価を行った。

【0017】すなわち、肌荒れ防止および肌荒れ改善効果については、女性健康人（顔面）の皮膚表面形態をシリコーン樹脂によるレプリカ法を用いて肌のレプリカを採り、顕微鏡（17倍）にて観察する。皮紋の状態および角層の剥離状態から表4に示す基準に基づいて肌荒れ評価1、2と判断された者（肌荒れパネル）110名を用い、顔面左右半々に、実施例1～10および比較例1～12で得たクリーム22種をそれぞれが10人に塗布されるように割り付け、1日2回塗布した。2週間後再

び顔面左右それぞれのレプリカを採り肌の状態を観察し、表4の判断基準に従って評価した。その結果を表5、6に示す。

【0018】肌のたるみとつやについては、前述のパネルの使用前後の肌状態を視観評価した。その結果を併せて表5、6に示す。

【0019】（視観評価）

◎：肌に非常にはりがあり、たるみがない。

○：肌にややはりがあり、たるみがない。

△：肌にあまりはりがなく、たるんだ感じがする。

×：肌にはりがなく、たるんでいる。

【0020】

【表4】

評点	評価
1	皮溝、皮丘の消失。広範囲の角層のめくれ。
2	皮溝、皮丘が不鮮明。角層のめくれ。
3	皮溝、皮丘が認められるが平坦。
4	皮溝、皮丘が鮮明。
5	皮溝、皮丘が鮮明で整っている。

【0021】

【表5】

実施例	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
レプリカ評価										
1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
2	0	1	1	0	0	1	0	0	1	0
3	2	1	0	2	3	2	1	2	2	2
4	2	2	3	1	1	2	3	2	1	1
5	6	6	6	7	6	5	6	6	6	7
視観評価										
使用前 ◎	0	1	1	0	0	1	1	0	0	0
○	2	2	3	2	1	4	2	3	3	2
△	5	4	5	6	4	4	3	5	4	3
×	3	3	1	2	5	1	4	2	3	5

7											8
使用後	◎	4	4	3	5	4	3	5	4	5	3
	○	6	5	6	3	3	5	5	4	4	5
	△	0	1	1	2	3	2	0	2	1	2
	×	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0

【0022】

【表6】

比較例	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12
レプリカ評価												
1	1	3	2	4	2	1	3	4	3	3	4	6
2	3	5	5	4	6	5	4	5	5	4	3	4
3	3	1	1	1	2	2	1	0	1	1	2	0
4	2	1	2	1	0	2	2	1	1	2	1	0
5	1	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
視観評価												
使用前	◎	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
	○	2	3	1	0	2	1	2	2	0	1	3
	△	3	4	5	6	2	5	4	7	7	5	4
	×	5	3	4	4	6	4	4	1	3	4	3
使用後	◎	1	0	1	0	1	0	0	0	1	0	0
	○	5	2	2	1	2	3	2	1	1	2	1
	△	3	5	4	5	6	4	3	4	5	4	6
	×	1	3	3	4	1	3	5	5	3	4	4

【0023】表5、6の結果より、特定の植物抽出物  
と、トラネキサム酸とを配合した化粧品を使用した顔面  
部位は他の化粧品を使用した顔面部位と比較し、顕著な  
肌荒れ防止・肌荒れ改善効果が認められること、また肌 30

のたるみ、つやについても大幅に改善されることが分か  
る。

【0024】

## 実施例11 クリーム

## A. ステアリン酸

10.0 重量%

ステアリルアルコール

4.0

ステアリン酸ブチル

8.0

ステアリン酸モノグリセリンエステル

2.0

ビタミンEアセテート

0.5

ビタミンAパルミテート

0.1

マカデミアナッツ油

1.0

香料

0.4

防腐剤

適量

## B. グリセリン

4.0

1, 2 ペンタンジオール

3.0

イチヤクソウエキス

1.0

水酸化カリウム

0.4

クララエキス (乾燥固形分として)

0.01

トラネキサム酸

0.1

アスコルビン酸リン酸マグネシウム

0.1

L-アルギニン塩酸塩

0.01

エリスリトール

1.0

エデト酸三ナトリウム

0.05

## 精製水

## 残余

(製法) Aの油相部とBの水相部をそれぞれ70℃に加熱し完全溶解する。A相をB相に加えて、乳化機で乳化する。乳化物を熱交換機を用いて冷却してクリームを得

た。

【0025】

## 実施例12 クリーム

A. セタノール	4.0 重量%
ワセリン	7.0
イソプロピルミリステート	8.0
スクワラン	15.0
ステアリン酸モノグリセリンエステル	2.2
POE (20) ソルビタンモノステアレート	2.8
ビタミンEニコチネート	2.0
香料	0.3
酸化防止剤	適量
防腐剤	適量
B. グリセリン	10.0
ジュウヤクエキス	0.01
ジプロピレングリコール	4.0
オトギリソウエキス (乾燥固形分として)	0.1
トラネキサム酸	5.0
ピロリドンカルボン酸ナトリウム	1.0
リジン	3.0
エドト酸二ナトリウム	0.01

## 精製水

## 残余

(製法) 実施例11に準じてクリームを得た。

【0026】

## 実施例13 乳液

A. スクワラン	5.0 重量%
オレイルオレート	3.0
ワセリン	2.0
ソルビタンセスキオレイン酸エステル	0.8
ポリオキシエチレンオレイルエーテル (20E0)	1.2
月見草油	0.5
香料	0.3
防腐剤	適量
B. 1, 3-ブチレングリコール	4.5
メリッサ抽出液	1.5
エタノール	3.0
カルボキシビニルポリマー	0.2
水酸化カリウム	0.1
L-アルギニンL-アスパラギン酸塩	0.01
チョウジエキス (乾燥固形分として)	0.0001
トラネキサム酸	0.5
エリスリトール	0.5
ヘキサメタリン酸ナトリウム	0.05

## 精製水

## 残余

(製法) 実施例11に準じて乳液を得た。

【0027】

## 実施例14 ファンデーション

A. セタノール	3.5 重量%
脱臭ラノリン	4.0
ホホバ油	5.0

11

12

ワセリン	2. 0
スクワラン	6. 0
ステアリン酸モノグリセリンエステル	2. 5
POE (60)硬化ヒマシ油	1. 5
POE (20)セチルエーテル	1. 0
ピリドキシントリパルミテート	0. 1
防腐剤	適量
香料	0. 3
B. プロピレングリコール	10. 0
調合粉末	12. 0
L-アルギニン	5. 0
アセンヤクエキス (乾燥固形分として)	0. 05
トラネキサム酸	0. 05
エデト酸三ナトリウム	0. 2
精製水	残余

(製法) 実施例11に準じてファンデーションを得た。 【0028】

#### 実施例15 化粧水

A. エタノール	5. 0 重量%
POEオレイルアルコールエーテル	2. 0
2-エチルヘキシル	
-P-ジメチルアミノベンゾエート	0. 18
香料	0. 05
B. 1, 3-ブチレングリコール	9. 5
ピロリドンカルボン酸ナトリウム	0. 5
ヒアルロン酸ナトリウム	0. 01
シコンエキス (乾燥固形分として)	0. 00001
トラネキサム酸	10. 0
ニコチン酸アミド	0. 3
グリセリン	5. 0
ヒドロキシプロピルβシクロデキストリン	1. 0
精製水	残余

(製法) Aのアルコール相をBの水相に添加し、可溶化して化粧水を得た。 【0029】

#### 実施例16 パック

(1) ポリビニルアルコール	10. 0 重量%
(2) ポリエチレングリコール (分子量400)	0. 4
(3) グリセリン	3. 0
(4) エタノール (95%)	8. 0
(5) ユキノシタエキス (乾燥固形分として)	0. 1
(6) トラネキサム酸	1. 0
(7) 防腐剤	0. 1
(8) 香料	0. 1
(9) 精製水	残余

(製法) 室温で(4), (7), (8)を混合溶解し、(1), (2), (3)および(5), (6), (9)を80℃で混合溶解した中に攪拌添加した後、室温まで放冷してパックを得た。

【0030】

【発明の効果】以上説明したように、本発明の皮膚外用

剤はエラスターゼ阻害効果のある植物抽出液とトラネキサム酸とを配合することで、肌荒れ改善効果、および皮膚のたるみ、つやの消失などを防いで老化を防止する効果を著しく増加させることができる利点を有するものである。

## フロントページの続き

(51) Int. Cl. <sup>7</sup>	識別記号	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 K 7/00		A 6 1 K 7/00	U
7/021		7/021	
31/222		31/222	
35/78		35/78	J
			C
			D
			Q
A 6 1 P 17/00		A 6 1 P 17/00	
43/00	1 1 1	43/00	1 1 1

F ターム (参考) 4C083 AA111 AA112 AA122 AB032  
 AB282 AC012 AC022 AC072  
 AC102 AC112 AC122 AC132  
 AC182 AC242 AC352 AC402  
 AC422 AC432 AC442 AC532  
 AC552 AC582 AC642 AC852  
 AD042 AD092 AD112 AD252  
 AD352 AD412 AD512 AD622  
 AD632 AD642 AD662 CC04  
 CC05 CC07 CC12 DD23 DD27  
 DD31  
 4C088 AB12 AB38 AB45 AB57 AB59  
 AB66 BA08 MA63 NA05 ZA89  
 ZC20 ZC75  
 4C206 AA01 AA02 FA44 MA02 MA04  
 MA83 NA05 ZA89 ZC20 ZC75